

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 54-154515

(43)Date of publication of application : 05.12.1979

(51)Int.Cl.

A61K 9/16

(21)Application number : 53-061043

(71)Applicant : KUREHA CHEM IND CO LTD

(22)Date of filing : 24.05.1978

(72)Inventor : SAKAUCHI NOBUO
KAWAKAMI MICHITOMO

(54) SLOWLY RELEASING DRUG

(57)Abstract:

PURPOSE: A slowly releasing drug having suppressed elution and absorption in the stomach, comprising a drug adsorbed on active carbon.

CONSTITUTION: 5W50%, preferably 10W40% of a drug, which is eluted in the intestinal juice, is adsorbed on bead-like or granular active carbon.

EFFECT: The drug is easily administered without a bad smell or taste, and scarcely eluted in the stomach. The active carbon is excreted together with faeces without any damage.

⑨日本国特許庁(JP)

⑪特許出願公開

⑫公開特許公報(A)

昭54—154515

⑥Int. Cl.²
A 61 K 9/16

識別記号 ⑤日本分類
30 C 42

庁内整理番号 ④公開 昭和54年(1979)12月5日
7057—4C

発明の数 1
審査請求 未請求

(全 3 頁)

⑭徐放性医薬品

⑫発明者 川上進盟

いわき市植田町根小屋25—13

⑮特 願 昭53—61043

⑮出 願 人 呉羽化学工業株式会社

⑯出 願 昭53(1978)5月24日

東京都中央区日本橋堀留町1丁

⑯発明者 坂内信男

目8番地

いわき市錦町釈迦堂33

⑯代理人 弁理士 渋谷理

明 細 書

1. 発明の名称

徐放性医薬品

2. 特許請求の範囲

1. 医薬品を活性炭に吸着保持せしめてなることを特徴とする胃での溶出、吸収を抑制した徐放性医薬品。

2. 活性炭がビーズ状活性炭である特許請求の範囲第1項記載の徐放性医薬品。

3. 発明の詳細な説明

本発明は徐放性医薬品に関し、詳しくは臭や味の不快感をなくし、薬剤の体内に於ける溶出速度を調整し、生物学的利用率を向上せしめるべく薬剤を活性炭に吸着保持せしめたものである。

病気の治療を目的として人体に投与される医薬品は服用に際しての臭や味の不快感がなく、服用量が最小限で効果が持続するような剤型であることが望ましい。また経口投与された医薬品の多くは胃内で短時間に溶解され、このため胃を荒すこ

とが多くある。従つて薬効を持続させるとともに胃に対する悪影響を少なくするべくマイクロカプセル化した医薬品が多数市販されており、例えばアスピリン、アセタミノフェノン、ババベリン、テトラサイクリンなどのマイクロカプセル化がある。

しかし医薬品のマイクロカプセル化に用いられる壁物質は一般に高分子材料であるが、これが人体に全く無害であること、即ち体内で分解しても蓄積されずにそのまま体外に排泄されること、更には薬剤が望ましい速度で溶出されることなどの厳しい制約があり、そのためコスト高となり実際には特殊なものを除きあまり利用されていない。

本発明者等は上述の問題を解決し、安価で容易に得ることが出来る徐放性医薬品について研究を続けた結果、薬剤を活性炭に担持せしめる本発明に至つた。

本発明は経口投与する医薬品を活性炭に担持せしめるものであつて、薬効の持続化を図るとともに胃に対する悪影響を回避し、併せて服用に際し

不快な臭や味を有する医薬品を飲み易くするものである。例えば鎮痛剤または解熱剤として広く用いられているアスピリンは胃で溶解され、副作用として胃粘膜刺激作用を有するため、通常胃腸薬と併せて服用することが多い。ところがこのアスピリンを活性炭に吸着担持させたものを服用する場合には、アスピリンは胃に於て殆んど溶出することなく、腸に於て徐々に溶出、吸収されるため、従来の薬剤の如く胃に対する刺激は全く起らず、しかも血中に於けるアスピリン濃度は従来の形態のアスピリン剤に比し長時間に亘つて高濃度に維持され、所謂生物学的利用率が高いものとなる。

ここで用いる活性炭は一般的には活性炭の原料や形状にかかわらず如何なる種類のものであつてもよいが、衛生性を考慮した場合には微粉末を含まないビーズ状または顆粒状の活性炭が最も好ましい。また本発明で活性炭に担持せしめる薬剤としては腸液で溶出するものであればよい。活性炭に対する医薬品の含浸量は任意に選ぶことができ

るが、5～50%好ましくは10～40%の範囲内とすることが効果的である。

活性炭への薬剤の担持させる方法は、薬剤が液体である場合は直接活性炭と混合吸着せし、また、薬剤が固体である場合には水または適当な有機溶剤に溶解せしめたものを活性炭に混合吸着担持させた後、水または有機溶剤を蒸発分離させるのが好ましい。

このような方法で得られた医薬品は服用に際し不快な臭や味もなく、飲み易いものであり、しかも胃での溶出吸収が殆んどなく腸で徐々に溶出、吸収されるものであり、活性炭自体は便と共に排泄され何ら害を与えるものではない。尚服用に際しこれを錠剤に成型してもよく、また糖衣粒剤等に加工して服用してもよい。

実施例 1

アスピリン原薬30gをエチルアルコール100ccに溶解し、これを粒径0.2～1.0mmの粒度分布を有するビーズ状活性炭100gと混合し、約10分間放置後減圧蒸留でエチルアルコールを留

去することにより、ビーズ状活性炭に吸着されたアスピリンを得た。これを夫々30gずつ人工胃液および人工腸液各々1Lに入れ、その溶出速度みた結果を第1図に示した。

第1図からも明らかな如く、アスピリンは人工胃液での溶出は極めて僅かであり、人工腸液で初めの2時間で約半量が溶出し後は徐々に長時間に亘つて溶出された。

実施例 2

実施例1と同様にして得たビーズ状活性炭に担持させたアスピリン4g(アスピリン量0.92g)を2匹の猿に経口投与し、15分後から採血しアスピリンの血中濃度を測定した。一方対照区として2匹の猿にアスピリンの標準錠剤(アスピリン量0.92g)を与え、同様にして血中のアスピリン濃度を測定した。その結果を第1表に示したように活性炭に吸着したアスピリンは標準錠剤に比し長時間に亘つて血中に高濃度に存在する。

第 1 表

測定時間(分)	アスピリン血中濃度(μg/100ml)				
	15	30	45	60	75
活性炭に吸着したアスピリン1	1.42	1.72	1.71	1.67	1.48
2	1.40	1.75	1.72	1.68	1.52
標準アスピリン錠1	2.5	0.6	0.1	0.02	0.01
2	2.52	0.59	0.09	0.02	0.01

4. 図面の簡単な説明

第1図はビーズ状活性炭に担持させたアスピリンの人工胃液および人工腸液での溶出速度を示すグラフである。

以 上

代理人 弁理士 渋谷 理

才 1 図

